

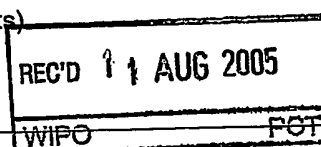
# TRAITÉ DE COOPÉRATION EN MATIÈRE DE BREVETS


## PCT

### RAPPORT PRÉLIMINAIRE INTERNATIONAL SUR LA BREVETABILITÉ

(chapitre II du Traité de coopération en matière de brevets)

(article 36 et règle 70 du PCT)



Référence du dossier du déposant ou du mandataire  	<b>POUR SUITE À DONNER</b> voir formulaire PCT/PEA/416	
Demande internationale No. PCT/FR2004/002021	Date du dépôt international (jour/mois/année) 28.07.2004	Date de priorité (jour/mois/année) 28.08.2003
Classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois classification nationale et CIB C07B37/04, C07B43/06, C07D231/12		
Déposant RHODIA CHIMIE et al.		
1. Le présent rapport est le rapport d'examen préliminaire international, établi par l'administration chargée de l'examen préliminaire international en vertu de l'article 35 et transmis au déposant conformément à l'article 36. 2. Ce RAPPORT comprend 6 feuilles, y compris la présente feuille de couverture.. 3. Ce rapport est accompagné d'ANNEXES, qui comprennent : a. <input type="checkbox"/> un total de (envoyées au déposant et au Bureau international) feuilles, définies comme suit : <input type="checkbox"/> les feuilles de la description, des revendications ou des dessins qui ont été modifiées et qui servent de base au présent rapport ou des feuilles contenant des rectifications autorisées par la présente administration (voir la règle 70.16 et l'instruction administrative 607). <input type="checkbox"/> des feuilles qui remplacent des feuilles précédentes, mais dont la présente administration considère qu'elles contiennent une modification qui va au-delà de l'exposé de l'invention qui figure dans la demande internationale telle qu'elle a été déposée, comme il est indiqué au point 4 du cadre n° I et dans le cadre supplémentaire. b. <input type="checkbox"/> (envoyées au Bureau international seulement) un total de (préciser le type et le nombre de support(s) électronique(s)) , qui contiennent un listage de la ou des séquences ou un ou des tableaux y relatifs, déposés sous forme déchiffrable par ordinateur seulement, comme il est indiqué dans le cadre supplémentaire relatif au listage de la ou des séquences (voir l'instruction administrative 802).		
4. Le présent rapport contient des indications et les pages correspondantes relatives aux points suivants : <input checked="" type="checkbox"/> Cadre n° I Base de l'opinion <input type="checkbox"/> Cadre n° II Priorité <input type="checkbox"/> Cadre n° III Absence de formulation d'opinion quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle <input type="checkbox"/> Cadre n° IV Absence d'unité de l'invention <input checked="" type="checkbox"/> Cadre n° V Déclaration motivée selon l'article 35(2) quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle; citations et explications à l'appui de cette déclaration <input type="checkbox"/> Cadre n° VI Certains documents cités <input type="checkbox"/> Cadre n° VII Irrégularités dans la demande internationale <input checked="" type="checkbox"/> Cadre n° VIII Observations relatives à la demande internationale		
Date de présentation de la demande d'examen préliminaire internationale 18.03.2005	Date d'achèvement du présent rapport 09.08.2005	
Nom et adresse postale de l'administration chargée de l'examen préliminaire international  Office européen des brevets D-80298 Munich Tél. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Fonctionnaire autorisé Bedel, C N° de téléphone +49 89 2399-	



**Demande internationale n°  
PCT/FR2004/002021**

**Case No. 1    Base du rapport**

1. En ce qui concerne la **langue**, le présent rapport est établi sur la base de la demande internationale dans la langue dans laquelle elle a été déposée, sauf indication contraire donnée sous ce point.
  - ☐ Le présent rapport est établi sur la base de traductions réalisées à partir de la langue d'origine dans la langue suivante ,qui est la langue d'une traduction remise aux fins de :
    - ☐ la recherche internationale (selon les règles 12.3 et 23.1.b))
    - ☐ la publication de la demande internationale (selon la règle 12.4)
    - ☐ l'examen préliminaire international (selon la règle 55.2 ou 55.3)
2. En ce qui concerne les **éléments\*** de la demande internationale, le présent rapport est établi sur la base des éléments suivants (*les feuilles de remplacement qui ont été remises à l'office récepteur en réponse à une invitation faite conformément à l'article 14 sont considérées dans le présent rapport comme "initialement déposées" et ne sont pas jointes en annexe au rapport.*) :

**Description, Pages**

**1-35**                               telles qu'initialement déposées

## Revendications, No.

1-29 reçue(s) le 09.12.2004 avec lettre du 19.11.2004

- ☐ En ce qui concerne un listage de la ou des séquences ou un ou des tableaux y relatifs, voir le cadre supplémentaire relatif au listage de la ou des séquences.
3. ☐ Les modifications ont entraîné l'annulation :
- ☐ de la description, pages
  - ☐ des revendications, nos
  - ☐ des dessins, feuilles/fig.
  - ☐ du listage de la ou des séquences (*préciser*) :
  - ☐ d'un ou de tous les tableaux relatifs au listage de la ou des séquences (*préciser*) :
4. ☐ Le présent rapport a été établi abstraction faite (de certaines) des modifications, qui ont été considérées comme allant au-delà de l'exposé de l'invention tel qu'il a été déposé, comme il est indiqué dans le cadre supplémentaire (règle 70.2.c)).
- ☐ de la description, pages
  - ☐ des revendications, nos
  - ☐ des dessins, feuilles/fig.
  - ☐ du listage de la ou des séquences (*préciser*) :
  - ☐ d'un ou de tous les tableaux relatifs au listage de la ou des séquences (*préciser*) :

\* Si le cas visé au point 4 s'applique, certaines ou toutes ces feuilles peuvent être revêtues de la mention "remplacé".

**RAPPORT PRÉLIMINAIRE INTERNATIONAL  
SUR LA BREVETABILITÉ**

Demande internationale n°  
PCT/FR2004/002021

---

**Cadre n° V Déclaration motivée selon l'article 35.2) quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle; citations et explications à l'appui de cette déclaration**

---

1. Déclaration
- |  |      |                |      |
|--|------|----------------|------|
| Nouveauté                              | Oui: | Revendications | 1-29 |
|  | Non: | Revendications |      |
| Activité inventive                     | Oui: | Revendications |      |
|  | Non: | Revendications | 1-29 |
| Possibilité d'application industrielle | Oui: | Revendications | 1-29 |
|  | Non: | Revendications |      |

2. Citations et explications (règle 70.7) :

**voir feuille séparée**

---

**Cadre n° VIII Observations relatives à la demande internationale**

---

Les observations suivantes sont faites au sujet de la clarté des revendications, de la description et des dessins et de la question de savoir si les revendications se fondent entièrement sur la description :

**voir feuille séparée**

1. La présente demande concerne un procédé très général de création de liaison C-C ou C-het à partir d'un composé insaturé porteur d'un groupe partant et d'un composé nucléophile en présence d'un catalyseur à base de cuivre, d'une base et d'un solvant de type nitrile ainsi qu'en l'absence d'un ligand.  
Les exemples ne divulguent que l'arylation de composés nucléophyles (C et hétéroatome).
2. A première vue, l'état de la technique divulgue seulement l'utilisation de catalyseur à base de cuivre en présence d'un ligand en général diamine ou parfois simplement porteur d'un hétéroatome (D1-D4).
  - 2.1 D1 divulgue un procédé de formation de liaison C-C ou C-hétéroatome, plus particulièrement l'arylation de pyrazole ou de composés acycliques azotés (hydrazone...).
  - Le cuivre est utilisé conjointement avec des ligands bidentés de type imine. Un certain nombre de solvants ont été testés et c'est l'acétonitrile qui semble le plus efficace.
  - La présente demande diffère donc de D1 uniquement par l'absence de ligand alors que dans D1 le cuivre est associé à un ligand.
  - 2.2 D4 divulgue un procédé d'arylation de diéthyl malonate en présence de CuI + ligand phénol, de CsCO<sub>3</sub> dans le THF. Un test comparatif est cependant signalé en l'absence de ligand : le rendement est de 80% (chute de 10% par rapport au test avec ligand phénol, voir p.272, note (23)).
  - Bien que l'enseignement de D4 peut sembler dissuader l'homme du métier de ne pas utiliser de ligand, les rendements obtenus par la présente demande sont toutefois très inférieurs à ceux de D1 et sont comparables voire même inférieur aux 80% de rendement obtenu par D4 en l'absence de ligand.
  - 2.3 Si on considère que le problème technique est d'obtenir les rendements obtenu par la présente demande, un homme du métier aurait combiné D1 avec D4 sans faire preuve d'activité inventive, car il sait par D4 que la présence de ligand n'est pas obligatoire pour que la réaction fonctionne même si le rendement obtenu est plus faible que dans D1 (80%).

Les rendements obtenus par la présente demande ne sont pas surprenants considérant le fait qu'ils sont nettement inférieurs à ceux obtenus en la présence de ligands (comparaison avec D1), fait confirmé par D4.

L'homme du métier aurait considéré cette solution alternative sans faire preuve d'activité inventive.

3. Le même raisonnement contre l'activité inventive est valable aussi en partant de l'exemple comparatif de D4 comme état de la technique le plus proche qui ne diffère que par le solvant utilisé, sachant que D1 encourage fortement l'utilisation de solvant nitrile.
4. D5 et D6 divulgue la même réaction en absence de ligand et de solvant par chauffage au micro onde. Les rendements obtenus se trouvent aussi dans la gamme de 80%.
5. De plus, les exemples donnés par la demanderesse semblent montrer que le substrat sur lequel doit se faire l'arylation doit porter un groupement susceptible de servir de ligand (phenol, pyrazole, diéthylmalonate). Autrement dit, l'absence de ligand doit d'une certaine façon être compensée par la présence dans le composé de départ d'hétéroatomes capables de se complexer avec le cuivre.  
Or, la présente demande couvre un domaine beaucoup plus large de composés de départ et donc il existe un doute sur le fait que le problème technique est effectivement résolu sur tout le domaine revendiqué.  
Pour cette raison aussi, la présente demande n'implique pas d'activité inventive.
6. Enfin, l'homme du métier sait bien que les réactions de substitution nucléophyles sont fortement dépendantes de nombreux facteurs comme les produits de départs, de leur encombrement stérique, des groupes partants etc... Or la demanderesse à partir de quelques exemples précis qui concernent tous l'arylation à partir d'iodure ou de bromure de benzène, les généralise à toute sorte de substrats insaturé porteur d'un groupe partant. La présente autorité considère qu'il y a un manque de support pour une telle généralisation (article 6 PCT) et donc que le problème technique n'est pas résolu sur tout le domaine revendiqué par la présente demande ce qui conduit aussi à un manque d'activité inventive (Article 33(3)PCT).

**RAPPORT PRÉLIMINAIRE INTERNATIONAL  
SUR LA BREVETABILITÉ  
(FEUILLE SÉPARÉE)**

Demande internationale n°

PCT/FR2004/002021

7. Il n'est actuellement pas possible de savoir quelle partie de la demande pourrait servir de base à une nouvelle revendication susceptible d'être admise. Toutefois, si certains éléments lui apparaissent brevetables, le demandeur est prié de justifier son point de vue en indiquant dans sa réponse toute différence par rapport à l'état de la technique et en précisant l'importance qu'elle revêt.